



2022年4月7日

各 位

会 社 名 ラクオリア創薬株式会社
代表者名 代表取締役 武内 博文
(コード番号：4579)
問 合 せ 先 取締役 須藤 正樹
(TEL. 052-446-6100)

胃食道逆流症治療薬tegoprazanの米国における第 I 相臨床試験完了のお知らせ

本日、当社の導出先であるHK inno. N Corporation（本社：韓国ソウル市、代表取締役：Dal-Won Kwak、以下「HKイノエン社」）は、当社からHKイノエン社へ導出した胃食道逆流症治療薬tegoprazan（韓国販売名（韓国登録商標）：K-CAB[®]、以下「tegoprazan」）につきまして、米国で行った第 I 相臨床試験（以下「本フェーズ 1 試験」）の完了を発表しましたのでお知らせいたします。

なお、本件は、東京証券取引所の規則に定める適時開示には該当いたしません、有用な情報と判断したため、任意開示いたします。

本フェーズ 1 試験は、tegoprazanの薬物動態^{*1}、薬動力学^{*2}および安全性を評価する目的で、2020年から米国でHKイノエン社によって行われていたものです。健康な成人30人が、tegoprazan 25 mg、tegoprazan 50 mg、tegoprazan 100 mgまたはプラセボ^{*3}の4群に無作為に割り付け^{*4}られ、これらの薬剤が1日1回、7日間投与されました。

本フェーズ 1 試験の結果、tegoprazanの血中濃度は投与量に比例し、投与1日目と7日目の両方で同様のプロファイルが維持されることが示されました。また、投与1日目と7日目における胃内pHを24時間にわたって計測したところ、被験者の胃内pHはtegoprazanの投与量に応じて上昇しプラセボ投与群より高い値となること、すなわち胃液の酸性度が下がることが示されました。さらに、全ての投与量においてtegoprazanの安全性と忍容性が確認されております。

Tegoprazanは、当社が創出したカリウムイオン競合型アシッドブロッカー（Potassium Competitive Acid Blocker：P-CAB）と呼ばれる新しい作用機序の胃酸分泌抑制剤です。P-CABは、胃食道逆流症治療の第一選択薬であるプロトンポンプ阻害剤（PPI）とは異なるメカニズムで、PPIよりも速やかに、かつ、持続的に胃酸分泌を抑制するという特長を持つ新世代の治療薬です。

Tegoprazanは、HKイノエン社により販売名「K-CAB[®]」として2019年から韓国で販売されており、2021年の韓国国内売上（院外処方実績）が1,096億ウォンに達する大型製品となっております。

当社は2010年9月に、HKイノエン社との間で、tegoprazanの東アジア地域を対象とした開発・販売及び製造の再実施許諾権（サブライセンス権）付き独占的ライセンス契約を締結しました。米国につきましては、2021年12月、HKイノエン社は米国の消化器疾患治療薬の専門企業であるBraintree

Laboratories, Inc. (本社：米国マサチューセッツ州ブレインツリー、以下「ブレインツリー社」)との間で、米国およびカナダにおける独占的な製造販売権に関するライセンス契約を締結しました。ブレインツリー社は、本フェーズ1試験の結果に基づいて米国およびカナダにおけるtegoprazanの臨床試験の準備を進めており、年内に新たな臨床試験を開始する予定です。

世界の消化性潰瘍治療剤の市場規模は約2兆円で、米国はそのうちおよそ2割を占めていると推測されています。現在、北米地域で販売されているP-CABはなく、同地域での胃食道逆流症の治療には主にPPIが用いられています。しかし、PPIでは効果がみられない胸やけ症状や食道粘膜障害を持つ患者が約40%を占めるなど、PPIを用いた治療の限界が指摘されています。Tegoprazanが胃食道逆流症治療の新たな選択肢としてこれらの未充足ニーズの解消に貢献することを当社は期待しております。

本フェーズ1試験の完了により当社が受け取る一時金はございませんが、当社は、HKイノエン社とのライセンス契約に基づき、開発段階の進展に応じたマイルストーンおよび一定料率の販売ロイヤルティを受け取る権利を保有しております。

当社は今後も引き続き、HKイノエン社との連携をより強固にし、開発支援並びにサブライセンス契約支援を継続して実施し、tegoprazanによる胃食道逆流症治療の選択肢を広げることで、患者さまのQOLの向上に一層貢献できるよう努めてまいります。

以上

<ご参考>

HKイノエン社の公式発表につきましては、韓国金融監督院電子公示システム(DART)におけるHKイノエン社による開示をご覧ください。

DART : <https://dart.fss.or.kr/dsaf001/main.do?rcpNo=20220407900377> (韓国語)

用語解説

※1 薬物動態：薬物が体内に投与されてから体外に排泄されるまでの過程のこと。投与された薬物は、吸収され、組織に分布し、肝臓等の酵素により代謝され、最終的に排泄されることによって体内から消失します。この過程の薬物濃度の変化の程度やパターン(プロファイル)を追うことで、薬物の有効性や安全性との関連性等を調べることができます。

※2 薬動力学：薬物が生体の機能に与える影響を、薬物の濃度、作用メカニズム、時間的変化等の観点から解析したもの。

※3 プラセボ：有効成分を含まない薬のこと。「偽薬(ぎやく)」といわれることもあります。

※4 無作為に割り付け：どの薬剤の投与や治療を受けるかを、特定の意図によらない(無作為な)方法によって決めること。公正中立な第三者によって被験者の特性や何らかの条件によらず決定されます。